

⑨日本国特許庁(JP) ⑩特許出願公開  
⑪公開特許公報(A) 昭54—144397

⑫Int. Cl.<sup>8</sup> ⑬識別記号 ⑭日本分類 ⑮庁内整理番号 ⑯公開 昭和54年(1979)11月10日  
C 07 D 471/04 16 E 612 6736—4C  
A 61 K 31/505 A B F 16 E 623  
A D Z 30 G 133.42  
(C 07 D 471/04 30 H 23  
C 07 D 221/00 30 H 612  
C 07 D 239/00)  
発明の数 1  
審査請求 未請求  
(全10頁)

⑰窒素橋頭を有する化合物の新規な製法

⑱特 願 昭53—49383  
⑲出 願 昭53(1978)4月27日  
⑳発 明 者 イシュトヴァーン・ヘルメツ  
ハンガリー国1056ブダペスト・  
モルナール・ウツツア53  
同 ゴルターン・メーサーロシュ  
ハンガリー国1113ブダペスト・  
チエドネキ・ウツツア6

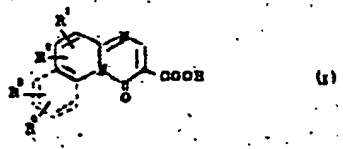
㉑発 明 者 アーグネシユ・ホルヴァート  
ハンガリー国1151ブダペスト・  
モルジヤ・ウツツア4  
㉒出 願 人 キノイン・ジョージセル・エー  
シユ・ヴェジエーセテイ・テル  
メーケク・ジャール・エルデー  
ハンガリー国ブダペストIVトー  
・ウツツア1—5  
㉓代 理 人 弁理士 松井政広 外2名  
最終頁に続く

1 発明の名称

窒素橋頭を有する化合物の新規な製法

2 特許請求の範囲

1. 窒素橋頭を有し、一般式(1)

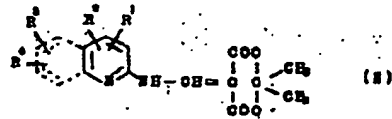


で表わされ、式中、  
Rが水素、ヒドロキシ基の置換基を有してもよい炭素原子数1〜10のアルキル、炭素原子数7〜13のアラルキル、または炭素原子数3〜7のシクロアルキル基であり、  
Rが水素、ハロゲン、炭素原子数1〜6のアルキル、炭素原子数1〜6のアルコキシ、炭素原子数3〜6のアルケニルオキシ、炭素原子数2〜6のアリールオキシ、炭素原子数7

〜13のアラルコキシ、炭素原子数1〜6のアルキルチオ、炭素原子数1〜6のアルコキシカルボニル、シアノ、炭素原子数1〜6のアシルオキシ、トリフルオロメチル、ニトロ、またはヒドロキシ基であり、  
Rが水素、ハロゲン、または炭素原子数1〜6のアルキル基であり、  
本願は、あつてもよい—(OR=OR)<sub>n</sub>—基であつて、かつ置換基RおよびR'を有してもよく、そのRとR'は同一でも異種でもよく、水素、ハロゲン、炭素原子数1〜6のアルキル、炭素原子数1〜6のアルコキシ、炭素原子数7〜13のアラルコキシ、炭素原子数1〜6のアルキルチオ、炭素原子数1〜6のアルキルスルフィニル、炭素原子数1〜6のアリールスルホニル、炭素原子数1〜6のアルコキシカルボニル基であり、  
RとR'がいつしよになつて2個の隣接する炭素原子に結合する炭素原子数1〜3のアリレンジオキシ基を形成してもよい化合物および置換基は基と共形成されるその基の置換基であつ

BEST AVAILABLE COPY

て、一般式(II)



で表わされ、式中、 $R^1, R^2$ 、点線部、 $R^3$ および $R^4$ が上に定義された通りであるイソプロピルピリジン・2-ヘプタール7,1/メチレンマロナート、を酸性融合剤の存在下で加熱させ、得られる反応混合物を一般式(IV)



で表わされ、式中の $R$ が上に定義されたのと同じ意味をもつアルコールで分解し、所望ならは得られる一般式(II)の化合物を一般式(II)の化合物であつて、式中 $R$ が異なる意味をもつ他の化合物に転化させ、および/もしくは、得られる一般式(II)の化合物を炭素または塩基と共に形成されるその塩に転化させ、および/もしくは、一般式(II)の化合物をその塩から遊離させることを

形成してもよい化合物を使用する方法。

2.特許請求の範囲第1項および第2項のいずれかの方法であつて、加熱を50 ないし100℃、好ましくは90 ないし150℃ の範囲で行なうことを含む方法。

3.特許請求の範囲第1項ないし第3項のいずれかの方法であつて、該反応混合物を分解するために水を使用する方法。

4.特許請求の範囲第1項ないし第4項のいずれかの方法であつて、該反応混合物を分解するために一般式(IV)のアルコールであつて、 $R$ がヒドロキシルの置換基を有してもよい炭素原子数1~10のアラルキル、炭素原子数7~13のアラルキル、炭素原子数3~7のシクロアラルキル基であるアルコールを使用する方法。

5.特許請求の範囲第1項ないし第5項と第6項のいずれかの方法であつて、該反応混合物を分解するためにメタノール、エタノール、ローブメノール、イソプロメノール、ローブメノール、

含む方法

2.特許請求の範囲第1項の方法であつて、出発化合物として一般式(II)の化合物であつて、式中 $R$ が水素、ヘロゲン、ヒドロキシル、炭素原子数1~6のアラルキル、炭素原子数3~7のアラルキル、炭素原子数3~7のアラルキルオキシ、炭素原子数3~6のアラルキルオキシ、炭素原子数1~6のアラルキルチオ、炭素原子数1~6のアロキシカルボニル、トリフルオロメチル基であり、

$R$ が水素、ヘロゲン、炭素原子数1~6のアロキシ基であり、該点線部があつてもよい(-OR=O)；一基であつて、かつ置換基 $R^3$ および $R^4$ を有してもよく、その $R^3$ と $R^4$ は同一でも異列でもよく、水素、炭素原子数1~6のアロキシ、炭素原子数1~6のアラルキルチオ、炭素原子数1~6のアラルキルスルフィニル、炭素原子数1~6のアラルキルスルホニル基であり、 $R^3$ と $R^4$ がいつしよになつて2個の炭素原子に結合するメチレンジオキシ基を

ール、ベンジルアルコール、またはシクロヘキサノールを使用する方法。

7.特許請求の範囲第1項ないし第7項のいずれかの方法であつて、得られる一般式(II)で表わされ、式中 $R$ がヒドロキシルの置換基を有してもよい炭素原子数1~10のアラルキル、炭素原子数7~13のアラルキル、炭素原子数3~7のシクロアラルキル基である化合物を、一般式(II)で表わされ、式中 $R$ が水素である他の化合物へ、希釈された塩基、好ましくは重炭酸の水酸化ナトリウム水溶液で行う加水分解とその後の酸性化によつて転化することを含む方法。

8.特許請求の範囲第1項ないし第7項のいずれかの方法であつて、一般式(II)で表わされ、式中 $R$ が水素の化合物を、一般式(II)で表わされ、式中 $R$ がヒドロキシルの置換基を有してもよい炭素原子数1~10のアラルキル、炭素原子数7~13のアラルキル、炭素原子数3~10のシクロアラルキル基である他の化合物へ、一般式(II)で表わされ、式中 $R$ が上記と同じ意味であるア

BEST AVAILABLE COPY